

ФЕДЕРАЛЬНЫЙ ИНСТИТУТ ПРОМЫШЛЕННОЙ СОБСТВЕННОСТИ

Выбор баз данных
Параметры поиска
Формулировка запроса
Уточненный запрос
Найденные документы
Корзина
Сохраненные запросы
Статистика
Помощь
Предложения
Выход

У Вас осталось
443 запроса
(132,9 у.е.)

Статус

(11) Номер публикации

(13) Вид документа

(14) Дата публикации

(19) Страна публикации

(21) Регистрационный номер
заявки

(22) Дата подачи заявки

(46) Дата публикации формулы
изобретения

(516) Номер редакции МПК

(51) Основной индекс МПК

(51) Основной индекс МПК

Название

(71) Имя заявителя

(72) Имя изобретателя

(72) Имя изобретателя

(72) Имя изобретателя

Предыдущий документ

Факсимильное изображение

Извещения об изменении правового статуса

прекратил действие (по данным
на 27.10.2004)

В связи с автоматической обработкой патентных
документов в цифровой формат точность поиска не
гарантируется и в представленной
библиографической информации возможны ошибки

1621447

A1

1996.02.27

Поиск

SU

04735287

1989.06.29

1996.02.27

Поиск

6

C07C237/42

Поиск

МПК

A61K31/165

Поиск

МПК

М, -(N-Трифторацетиламино)
бензамид, обладающий
радиосенсибилизирующей
активностью

НАУЧНО-ИССЛЕДОВАТЕЛЬСКИЙ
ИНСТИТУТ ВОЕННОЙ

МЕДИЦИНЫ

Поиск

Арапов О.В.

Поиск

Алферова О.Ф.

Поиск

Красильников И.И.

Поиск

Извещения об изменении правового статуса

Код изменения правового
статуса

РА4А - Прекращение действия
авторского свидетельства СССР
на территории РФ и выдача
патента РФ на оставшийся срок
(32/97)

ДОКУМЕНТ
в начало
в конец
в корзину
ТЕРМИНЫ
предыдущий
следующий

Номер бюллетеня	16/1997
Дата публикации бюллетеня	1997.06.10
(73) Имя патентообладателя	НИИ ВОЕННОЙ МЕДИЦИНЫ

Код изменения правового
статуса

МН4А - Досрочное прекращение
действия патента РФ на основе
заявления, поданного
патентообладателем в
Патентное ведомство

Номер бюллетеня
Дата публикации бюллетеня
Дата прекращения действия
патента

15/1998
1998.05.27
1998.03.20

Факсимильное изображение

Предыдущий документ



(19) SU (11) 1621447 (13) A1

(51) 6 C 07 C 237/42,
A 61 K 31/165

Комитет Российской Федерации
по патентам и товарным знакам

ВСЕРОССИЙСКАЯ
ПАТЕНТНО-ТЕХНИЧЕСКАЯ
БИБЛИОТЕКА

(12) **ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ**
к авторскому свидетельству

(21) 4735287/04

(22) 29.06.89

(46) 27.02.96 Бюл. № 6

(72) Арапов О.В., Алферова О.Ф., Красильников И.И.

(56) Авторское свидетельство СССР N 689140, кл. C 07C 103/46, 1978. Бизер В.А. и др. Содержание метронидазола в нормальных опухолевых тканях при комбинированном лечении больных с остеогенной саркомой. Мед. радиобиология, 1987, N 6, с.86-88.

(54) м-(N-ТРИФТОРАЦЕТИЛАМИНО)БЕНЗАМИД, ОБЛАДАЮЩИЙ РАДИОСЕНСИБИЛИЗИРУЮЩЕЙ АКТИВНОСТЬЮ
(57) Изобретение относится к замещенным амидам ароматических кислот, в частности к м-(N-трифторацетиламино)бензамиду, обладающему радиосенсибилизирующей активностью. Цель - выявление более активных соединений. Получение ведут из м-аминобензамида в этилацетате и триэтиламина и трифторуксусного ангидрида. Выход 70%, т. пл. 240°C, брутто ф-ла $C_9H_7F_3N_2O_2$. 1 табл.

SU
1621447
A1

SU 1621447 A1

Изобретение относится к новому биологически активному химическому соединению, а именно к м-(N-трифторацетиламино)бензамиду, обладающему радиосенсибилизирующей активностью.

Указанное свойство позволяет предполагать возможность использования нового соединения в медицине в лучевой терапии.

Целью изобретения является изыскание нового соединения с высокой радиосенсибилизирующей активностью в ряду бензамидов.

Пр и м е р. В трехгорлую колбу, снабженную мешалкой, холодильником и капельной воронкой, помещают 4,38 г (0,03 моль) М-аминобензамида, растворенного в 20 мл этилацетата и 3 г (0,03 моль) триэтиламина. При охлаждении и перемешивании прикапывают 6,3 г (0,03 моль) трифторуксусного ангидрида. По окончании прикапывания реакционную колбу нагревают до комнатной температуры, а затем выдерживают на водяной бане 2 ч при 80°C. По охлаждении выпавший осадок фильтруют. Фильтрат промывают водой и сушат над $MgSO_4$. После отгонки растворителя получают чистый кристаллический продукт с т. пл. 240°C, выход 4,9 г (70%).

Найдено, %: С 46,41; Н 3,14; N 11,95.

$C_9H_7F_3N_2O_2$.

Вычислено, %: С 46,55; Н 3,02; N 12,07.

Хроматографию ведут на пластинках "Silufol", элюирующая смесь эфир-этилацетат 1:3, $R_f = 0,4$.

УФ спектр (спирт, λ_{max}): 290 нм (плечо).

ИК-спектр (KBr): 3380, 3316, 3168, 3100, 1706, 1662, 1588 cm^{-1} .

Новое соединение было испытано на радиосенсибилизирующую активность и острую токсичность.

Количественно радиосенсибилизирующий эффект нового соединения оценивали по снижению числа селезеночных эндокolonий у мышей после общего γ -облучения.

Опыты были поставлены на беспородных мышах-самцах массой 18–20 г. Препарат вводили в виде водной суспензии на твине-80 перорально за 1 ч до облучения.

Контрольные животные тем же путем получали физиологический раствор. В каждой группе было по 10 животных. Животных облучали на установке "ИГУР" в дозе 6,0 Гр при мощности облучения 1,65 Гр/мин. Через 8 сут после облучения мышей забивали, взвешивали их селезенки и подсчитывали число эндокolonий образованных на селезенках стволовыми клетками костного мозга.

Острую токсичность оценивали в условиях внутрибрюшинного введения препарата по критерию CD_{50} , вычисленного по методу Беренса.

Для сравнения использовали известный препарат метронидазол.

Терапевтическую широту сравниваемых веществ оценивали как отношение CD_{50} к их эффективным дозам.

Результаты приведены в таблице. Результаты эксперимента показывают, что новое соединение обладает выраженным радиосенсибилизирующим эффектом при малых эффективных дозах введения (1,0 мг/кг) и большой терапевтической широтой.

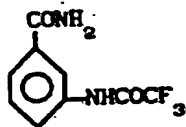
Сравнительная радиосенсибилизирующая активность соединения I и прототипа

Препарат	Доза препарата, мг/кг	Среднее число селезеночных эндокolonий	CD_{50} препарата, мг/кг	Ориентировочная терапевтическая широта
Контроль облучения м-(N-трифторацетиламино)бензамид	-	$32,6 \pm 7,6$	-	-
	1,0	$13,0 \pm 3,6$	>3000	>3000
Контроль облучения Метронидазол	-	$21,1 \pm 3,5$	-	-
	1000,0	$12,0 \pm 2,4$	4500	4,5

Ф о р м у л а и з о б р е т е н и я

М-(N-ТРИФТОРАЦЕТИЛАМИНО)БЕН
ЗАМИД, ОБЛАДАЮЩИЙ РАДИОСЕНСИ-
БИЛИЗИРУЮЩЕЙ АКТИВНОСТЬЮ

М-(N-трифторацетиламино)бензамид
формулы



5

обладающий радиосенсибилизирую-
щей активностью.

Редактор	М.Самерханова	Составитель В.Мякушева	Корректор	М.Керецман
		Техред М.Моргентал		

Заказ 1613

Тираж
НПО "Поиск" Роспатента
113035, Москва, Ж-35, Раушская наб., 4/5

Подписное

Производственно-издательский комбинат "Патент", г. Ужгород, ул. Гагарина, 101

DialogWeb™

6/19/1 DIALOG(R)File 351:Derwent WPI (c) 2004 Thomson Derwent. All rts. reserv.

010914115 **Image available**

WPI Acc No: 1996-411066/ 199641

XRAM Acc No: C96-129490

New meta-N-trifluoro-acetyl-amino-benzamide cpd. - has
pronounced radio-sensitising activity at low dosage

Patent Assignee: ARAPOV O V (ARAP-I)

Inventor: ALFEROVA O F; ARAPOV O V; KRASILNIKOV I I

Number of Countries: 001 Number of Patents: 001

Patent Family:

Patent No	Kind	Date	Applicat No	Kind	Date	Week
SU 1621447	A1	19960227	SU 4735287	A	19890629	199641 B

Priority Applications (No Type Date): SU 4735287 A 19890629

Patent Details:

Patent No	Kind	Lan	Pg	Main IPC	Filing Notes
SU 1621447	A1	3		C07C-237/42	

Abstract (Basic): SU 1621447 A

The cpd. meta-(N-trifluoroacetyl-amino) benzamide cpd. of formula

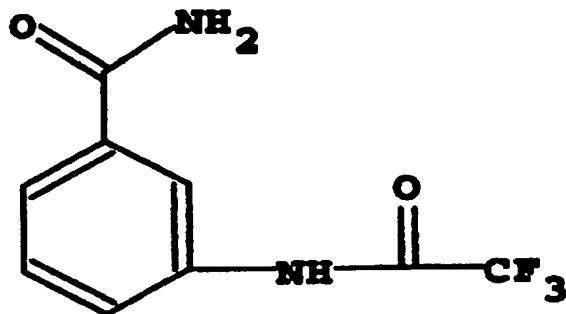
(I) is new:

(I) may be prepd. by reacting m-aminobenzamide (II) (in ethyl acetate) with triethylamine and trifluoroacetic anhydride (III).

USE - Possible application in medicine as prepn. increases responsiveness of organism to ionising radiation.

ADVANTAGE - The cpd. exhibits a marked radio-sensitising effect in vivo to 1.0 mg/kg dosage.

Dwg.0/0



Title Terms: NEW; META; N; TRI; FLUORO; ACETYL; AMINO; BENZAMIDE; COMPOUND;
PRONOUNCED; RADIO; SENSITIVE; ACTIVE; LOW; DOSE

Derwent Class: B05

International Patent Class (Main): C07C-237/42

International Patent Class (Additional): A61K-031/165

File Segment: CPI

Manual Codes (CPI/A-N): B10-D03

Chemical Fragment Codes (M2):

01 G012 G100 H6 H685 J0 J012 J3 J331 J341 M280 M311 M321 M344 M349 M362
M391 M414 M510 M520 M531 M540 M710 M903 M904 9641-24301-N

Derwent Registry Numbers: 1246-S

Generic Compound Numbers: 9641-24301-N

Derwent WPI (Dialog® File 351): (c) 2004 Thomson Derwent. All rights reserved.

©1997-2004 Dialog, a Thomson business - Version 2.5